

ACRYLONITRILE COMPOUND

Patent number: JP2000290279
Publication date: 2000-10-17
Inventor: MURAKAMI HIROSHI; NUMATA AKIRA; UENO HIDEKI;
MIYAKE TOSHIRO; TAKII SHINJI; ITO TOSHINORI
Applicant: NISSAN CHEMICAL IND LTD
Classification:
- international: **A01N43/653; C07D401/14; C07D403/06; C07D405/14;**
A01N43/64; C07D401/00; C07D403/00; C07D405/00;
(IPC1-7): C07D403/06; A01N43/653; C07D401/14;
C07D405/14
- european:
Application number: JP19990100512 19990407
Priority number(s): JP19990100512 19990407

Report a data error here

Abstract of JP2000290279

PROBLEM TO BE SOLVED: To obtain a new acrylonitrile compound capable of exhibiting an excellent pest control activity and useful as a new insecticide or a new germicide. **SOLUTION:** This acrylonitrile compound is represented by formula I (A is a 1-6C alkyl, a 2-6C alkenyl or the like; R1 is H, a 1-12C alkyl, a 2-12C alkenyl or the like; R2 is H, a 1-4C alkyl, a 2-4C alkoxyalkyl or the like; R3 is a 1-4C alkyl, a 2-4C alkenyl, a 1-4C haloalkyl or the like; R4 and R5 are each H, OH, SH, NH2, a halogen, a 1-4C alkyl or the like), e.g. 3-(1,4- dimethylpyrazol-5-yl)-3-hydroxy-2-(1-methyl-3-phenyl-1,2,4-triazol-5-yl)-acrylonitrile. The compound represented by formula I can be obtained by reacting a cyanomethyltriazole derivative represented by formula II with a carboxylic acid derivative represented by formula III (L1 is a leaving group) in the presence of a base and further reacting the resultant compound with a compound represented by formula IV (L2 is a leaving group).

Data supplied from the **esp@cenet** database - Worldwide

(19) 日本国特許庁 (J P)

(12) 公 開 特 許 公 報 (A)

(11) 特許出願公開番号

特開2000-290279

(P2000-290279A)

(43) 公開日 平成12年10月17日 (2000. 10. 17)

(51) Int.Cl. ⁷	識別記号	F I	テームト [*] (参考)
C 0 7 D 403/06		C 0 7 D 403/06	4 C 0 6 3
A 0 1 N 43/653		A 0 1 N 43/653	L 4 H 0 1 1
C 0 7 D 401/14		C 0 7 D 401/14	
405/14		405/14	

審査請求 未請求 請求項の数 6 O L (全 16 頁)

(21) 出願番号 特願平11-100512

(22) 出願日 平成11年4月7日 (1999. 4. 7)

(71) 出願人 000003986

日産化学工業株式会社

東京都千代田区神田錦町3丁目7番地1

(72) 発明者 村上 博

千葉県船橋市坪井町722番地1 日産化学
工業株式会社中央研究所内

(72) 発明者 沼田 昭

千葉県船橋市坪井町722番地1 日産化学
工業株式会社中央研究所内

(72) 発明者 植野 英樹

千葉県船橋市坪井町722番地1 日産化学
工業株式会社中央研究所内

最終頁に続く

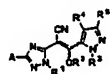
(54) 【発明の名称】 アクリロニトリル化合物

(57) 【要約】

【課題】 新規な農薬、特に殺虫、殺ダニ剤を提供する。

【解決手段】 式(1)：

【化1】

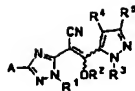


[式中、AはフェニルまたはC₁~C₄アルキルなどであり、R¹はC₁~C₁₂アルキルなどであり、R²はH、C₁~C₄アルキル、C₁~C₄アルキルカルボニルまたはC₂~C₄アルコキシアルキルなどであり、R³はC₁~C₄アルキルなどであり、R⁴及びR⁵はH、ハロゲン、C₁~C₄アルキルなどである。]で表されるアクリロニトリル化合物。

【特許請求の範囲】

【請求項1】 式(1)：

【化1】



〔式中、AlはC₁~C₆アルキル、C₂~C₆アルケニル、C₁~C₆ハロアルキル、C₁~C₄アルキルで置換されていてもよいC₃~C₇シクロアルキル、Xで置換されていてもよいフェニル、ナフチルまたはピリジニルであり、

R¹はH、C₁~C₁₂アルキル、C₂~C₁₂アルケニル、C₁~C₁₂ハロアルキル、C₁~C₄アルキルで置換されていてもよいC₃~C₇シクロアルキル、C₂~C₁₂アルキルスルフェニルアルキル、C₂~C₁₂アルキルスルフィニルアルキル、C₂~C₁₂アルキルスルフォニルアルキル、C₂~C₁₂アルコキシアルキル、フェニルで置換されたC₁~C₃アルキル、Xで置換されていてもよいフェニル、COOR^a、CONHR^b、CONR^aR^b、COR^aまたはCO(N-ヒベリジニル)であり、

R²はH、C₁~C₄アルキル、C₂~C₄アルコキシアルキル、C 20
H₂SCl₃、CH₂OC₂H₄OC₂H₅、RcもしくはRdで置換されたC₁~
C₄アルキル、テトラヒドロピラニル、トリメチルシリ
ル、SO₂Re、SO₂NHRb、SO₂NRaRb、C(S)NHRb、C(S)NRaR
b、CH₂CO₂Ra、C(O)Rf、C(O)RgRh、P(S)RgRh、アルカリ
金属、アルカリ土類金属またはNHRiRjRkであり、

Xはハロゲン、C₁~C₄アルキル、C₂~C₄アルケニル、C₁~C₄ハロアルキル、C₁~C₄アルコキシ、C₁~C₄ハロアルコキシ、C₁~C₄アルコキシアルキル、C₁~C₄アルキルスルフェニル、C₁~C₄アルキルスルフィニル、C₁~C₄アルキルスルフォニル、C₁~C₄ハロアルキルスルフェニル、C₁~C₄ハロアルキルスルフィニル、C₁~C₄ハロアルキルスルフォニル、NO₂、CN、フェニルおよびフェノキシの中から任意に選ばれる1ないし3個の置換基であり、R⁴およびR⁵は各々独立にH、OH、SH、NH₂、ハロゲン、C₁~C₄アルキル、C₂~C₄アルケニル、C₁~C₄ハロアルキル、C₁~C₄アルコキシ、C₁~C₄ハロアルコキシ、C₁~C₄アルコキシアルキル、C₁~C₄アルキルスルフェニル、C₁~C₄アルキルスルフィニル、C₁~C₄アルキルスルフォニル、C₁~C₄ハロアルキルスルフェニル、C₁~C₄ハロアルキルスルフィニル、C₁~C₄ハロアルキルスルフォニル、NO₂またはCNであり。

R³はC₁～C₄アルキル、C₂～C₄アルケニル、C₁～C₄ハロアルキルまたはC₁～C₄アルコキシアルキルであり、

RaはC₁~C₆アルキルであり、

R_1 はH、 $C_1 \sim C_6$ アルキルまたはI¹で置換されていてもよいフェニルであり、

Rc1はハロゲン、C1～C4アルキル、C2～C4アルケニル、C1～C4ハロアルキル、C1～C4アルコキシ、C1～C4ハロアルコキシ、C1～C4アルコキシアルキルの中から任意に選ばれた1種以上で置換されていてもよいフェニルであり、

Rdはハロゲン、C₁~C₄アルキル、C₂~C₄アルケニル、C₁~C₄ハロアルキル、C₁~C₄アルコキシ、C₁~C₄ハロアルコキシ、C₁~C₄アルコキシアルキルの中から任意に選ば
れる1種以上で置換されてもよいベンゾイルであり、
RelはC₁~C₄アルキル、C₂~C₄アルケニル、C₁~C₄ハロアル
キルまたはFで置換されていてもよいフェニルであ
り。

RfはC₁~C₆アルキル、C₂~C₆アルケニル、C₁~C₆ハロアルキル、C₂~C₄アルコキシアルキル、C₃~C₆ハロシクロアルキル、Rcで置換されたC₁~C₄アルキル、C₁~C₄アルキルで置換されていてもよいC₃~C₇シクロアルキル、RcおよびC₁~C₄アルキルで置換されたシクロプロピル、Rc及びハロゲンで置換されたC₃~C₄シクロアルキル、T²およびC₁~C₄アルキルで置換されたシクロプロピル、Rcで置換されたC₂~C₄アルケニル、C₁~C₆アルコキシ、C₁~C₄ハロアルコキシ、C₂~C₆アルケニルオキシ、C₁~C₄アルキルで置換されていてもよいC₃~C₆シクロアルコキシ、ベンジルオキシ、COORa、-NU¹U²、T³で置換されていてもよいフェニル、ナフチル、T¹で置換されていてもよいピリジニルまたはフェニルC₁~C₆アルキルであり、

Rg及びRhは各々独立に、OH、C₁〜C₆アルキル、C₁〜C₆アルコキシまたはC₁〜C₄アルキルスルフェニルであり、Ri、Rj及びRkは各々独立に、H、フェニル、C₁〜C₆アルキル、C₁〜C₄アルケニル、C₁〜C₄アルケニルオキシ、C₁〜C₃アルキルで置換されていてもよいC₃〜C₆シクロアルキルまたはベンジルであるか、あるいはRi、Rj及びRkのうちの2個が、それぞれが結合している窒素原子と共に酸素原子、窒素原子または硫黄原子を含有していてもよい5ないし8員環基を形成してもよく、

30 T¹は、ハロゲン、C₁~C₄アルキル、C₁~C₄ハロアルキル
またはC₁~C₄アルコキシであり、

T₂は、ハロゲンで置換されていてもよいC₂~C₄アルケニルであり、

T^3 は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスフェニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスフォニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスフェニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスフィニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスフォニル、 NO_2 、 CN 、 CHO 、 $-NUP^U$ 、フェニル及びフェノキシの中から任意に選ばれる1ないし5個の置換基であり、

U および U² は、各々独立に、H、C₁—C₆アルキル、COOR^a、フェニルまたはベンジルを表すか、あるいはU¹ とU² とが結合している窒素原子とともに酸素原子、窒素原子または硫黄原子を含有していてもよい5ないし8員環基を形成してもよい。] で表されるアクリロニトリル化合物。

【請求項2】 Aはフェニルであり、

R^1 は $C_1 \sim C_6$ アルキルであり、

R^2 はHまたは $C(0)R_f$ であり、

50

R³はC₁~C₆アルキルであり、
R⁴はH、ハロゲン、C₁~C₆アルキルまたはC₁~C₆アルコキシであり、
R⁵はHまたはC₁~C₆アルキルであり、
RfはC₁~C₆アルキルである請求項1記載のアクリロニトリル化合物。

【請求項3】 R¹はメチルまたはノルマルヘキシルであり、

R³はメチルであり、

R⁴はH、塩素原子、メチルまたはメトキシであり、

R⁵はH、メチルまたはエチルであり、

Rfはターシャリーブチルである請求項2記載のアクリロニトリル化合物。

【請求項4】 Alはフェニルであり、

R¹はC₁~C₆アルキルであり、

R²はHまたはC(O)Rfであり、

R³はC₁~C₆アルキルであり、

R⁴はH、ハロゲンまたはC₁~C₆アルキルであり、

R⁵はHまたはC₁~C₆アルキルであり、

RfはC₁~C₆アルキルである請求項1記載のアクリロニトリル化合物。

【請求項5】 R¹はメチルまたはノルマルヘキシルであり、

R³はメチルであり、

R⁴はH、塩素原子またはメチルであり、

R⁵はHまたはメチルであり、

Rfはターシャリーブチルである請求項4記載のアクリロニトリル化合物。

【請求項6】 請求項1~5記載のアクリロニトリル化合物の1種以上を有効成分として含有することを特徴とする農薬。

【発明の詳細な説明】

【0001】

【発明の属する技術分野】 本発明は、新規なアクリロニトリル化合物ならびに該化合物を有効成分として含有することを特徴とする農薬に関するものである。本発明における農薬とは、殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、除草剤及び殺菌剤などであり、特に農園芸、畜産、衛生分野の殺虫剤、殺ダニ剤及び殺線虫剤である。

【0002】

【従来の技術】 農薬としてのアクリロニトリル誘導体に関しては、W097/40009、W098/42683に記載がある。

【0003】

【発明が解決しようとする課題】 殺虫剤や殺菌剤の長年にわたる使用により、近年、病害虫が抵抗性を獲得し、従来の殺虫剤や殺菌剤による防除が困難になっている。よって本発明の課題は、優れた有害生物防除活性を示す新規な殺虫剤や殺菌剤を提供することにある。

【0004】

【課題を解決するための手段】 本発明者らは、上記の課

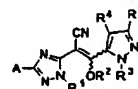
題を解決するために研究を続けた結果、下記の化合物が優れた有害生物防除活性を示すことを見出し本発明を完成した。

【0005】 すなわち本発明は、下記〔1〕~〔5〕に記載の化合物（以下、本発明化合物と称す。）及び下記〔6〕に記載の該化合物を有効成分として含有する農薬に関するものである。

【0006】〔1〕 式（1）：

【0007】

10 【化2】



【0008】〔式中、AlはC₁~C₆アルキル、C₂~C₆アルケニル、C₁~C₆ハロアルキル、C₁~C₄アルキルで置換されていてもよいC₃~C₇シクロアルキル、Xで置換されていてもよいフェニル、ナフチルまたはピリジニルであり、R¹はH、C₁~C₁₂アルキル、C₂~C₁₂アルケニル、C₁~C₁₂ハロアルキル、C₁~C₄アルキルで置換されていてもよいC₃~C₇シクロアルキル、C₂~C₁₂アルキルスルフェニルアルキル、C₂~C₁₂アルキルスルフィニルアルキル、C₂~C₁₂アルキルスルフォニルアルキル、C₂~C₁₂アルコキシアルキル、フェニルで置換されたC₁~C₃アルキル、Xで置換されていてもよいフェニル、COORa、CONHRb、CONRaRb、CORaまたはCO(N-ビペリジニル)であり、R²はH、C₁~C₄アルキル、C₂~C₄アルコキシアルキル、CH₂SCl₃、CH₂OC₂H₄OCH₃、RcもしくはRdで置換されたC₁~C₄アルキル、テトラヒドロピラニル、トリメチルシリル、SO₂Re、SO₂NHRb、SO₂NRaRb、C(S)NHRb、C(S)NRaRb、CH₂Cl₂Ra、C(O)Rf、P(O)RgRh、P(S)RgRh、アルカリ金属、アルカリ土類金属またはNHRIRjRkであり、

【0009】Xはハロゲン、C₁~C₄アルキル、C₂~C₄アルケニル、C₁~C₄ハロアルキル、C₁~C₄アルコキシ、C₁~C₄ハロアルコキシ、C₁~C₄アルコキシアルキル、C₁~C₄アルキルスルフェニル、C₁~C₄アルキルスルフィニル、C₁~C₄アルキルスルフォニル、C₁~C₄ハロアルキルスルフェニル、C₁~C₄ハロアルキルスルフィニル、C₁~C₄ハロアルキルスルフォニル、NO₂、CN、フェニルおよびフェノキシの中から任意に選ばれる1ないし3個の置換基であり、R⁴およびR⁵は各々独立にH、OH、SH、NH₂、ハロゲン、C₁~C₄アルキル、C₂~C₄アルケニル、C₁~C₄ハロアルキル、C₁~C₄アルコキシ、C₁~C₄ハロアルコキシ、C₁~C₄アルコキシアルキル、C₁~C₄アルキルスルフェニル、C₁~C₄アルキルスルフィニル、C₁~C₄アルキルスルフォニル、C₁~C₄ハロアルキルスルフェニル、C₁~C₄ハロアルキルスルフィニル、C₁~C₄ハロアルキルスルフォニル、NO₂またはCNであり、R³はC₁~C₄アルキル、C₂~C₄アルケニル、C₁~C₄ハロアルキルまたはC₁~C₄アルコキシアルキルであり、

【0010】RafはC₁~C₆アルキルであり、RbfはH、C₁~C₆アルキルまたはT¹で置換されていてもよいフェニルであり、Rciはハロゲン、C₁~C₄アルキル、C₂~C₄アルケニル、C₁~C₄ハロアルキル、C₁~C₄アルコキシ、C₁~C₄ハロアルコキシ、C₁~C₄アルコキシアルキルの中から任意に選ばれる1種以上で置換されていてもよいフェニルであり、Rdiはハロゲン、C₁~C₄アルキル、C₂~C₄アルケニル、C₁~C₄ハロアルキル、C₁~C₄アルコキシ、C₁~C₄ハロアルコキシ、C₁~C₄アルコキシアルキルの中から任意に選ばれる1種以上で置換されていてもよいベンジルであり、RelはC₁~C₄アルキル、C₂~C₄アルケニル、C₁~C₄ハロアルキルまたはT¹で置換されていてもよいフェニルであり、

【0011】RfiはC₁~C₆アルキル、C₂~C₆アルケニル、C₁~C₆ハロアルキル、C₂~C₄アルコキシアルキル、C₃~C₆ハロシクロアルキル、Rcで置換されたC₁~C₄アルキル、C₁~C₄アルキルで置換されていてもよいC₃~C₇シクロアルキル、RcおよびC₁~C₄アルキルで置換されたシクロプロピル、Rc及びハロゲンで置換されたC₃~C₄シクロアルキル、T²およびC₁~C₄アルキルで置換されたシクロプロピル、Rcで置換されたC₂~C₄アルケニル、C₁~C₆アルコキシ、C₁~C₄ハロアルコキシ、C₂~C₆アルケニルオキシ、C₁~C₄アルキルで置換されていてもよいC₃~C₆シクロアルコキシ、ベンジルオキシ、COORa、-NUP¹U²、T³で置換されていてもよいフェニル、ナフチル、T¹で置換されていてもよいピリジニルまたはフェニルC₁~C₆アルキルであり、Rg及びRhは各々独立に、OH、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆アルコキシまたはC₁~C₄アルキルスルフェニルであり、

【0012】Ri、Rj及びRkは各々独立に、H、フェニル、C₁~C₆アルキル、C₁~C₄アルケニル、C₁~C₄アルケニルオキシ、C₁~C₃アルキルで置換されていてもよいC₃~C₆シクロアルキルまたはベンジルであるか、あるいはRi、Rj及びRkのうちの2個が、それぞれが結合している窒素原子と共に酸素原子、窒素原子または硫黄原子を含有していてもよい5ないし8員環基を形成してもよく、T¹は、ハロゲン、C₁~C₄アルキル、C₁~C₄ハロアルキルまたはC₁~C₄アルコキシであり、T²は、ハロゲンで置換されていてもよいC₂~C₄アルケニルであり、

【0013】T³は、ハロゲン、C₁~C₄アルキル、C₁~C₄ハロアルキル、C₁~C₄アルコキシ、C₁~C₄ハロアルコキシ、C₁~C₄アルキルスルフェニル、C₁~C₄アルキルスフィニル、C₁~C₄アルキルスフォニル、C₁~C₄ハロアルキルスルフェニル、C₁~C₄ハロアルキルスフィニル、C₁~C₄ハロアルキルスフォニル、NO₂、CN、CHO、-NUP¹U²、フェニル及びフェノキシの中から任意に選ばれる1ないし5個の置換基であり、U¹およびU²は、各々独立に、H、C₁~C₆アルキル、COORa、フェニルまたはベンジルを表すか、あるいはU¹とU²とが結合している窒素原子とともに酸素原子、窒素原子または硫黄原子を含有していてもよ

い5ないし8員環基を形成してもよい。]で表されるアクリロニトリル化合物。

【0014】〔2〕 Alはフェニルであり、R¹はC₁~C₆アルキルであり、R²はHまたはC(O)Rfであり、R³はC₁~C₆アルキルであり、R⁴はH、ハロゲン、C₁~C₆アルキルまたはC₁~C₆アルコキシであり、R⁵はHまたはC₁~C₆アルキルであり、RfはC₁~C₆アルキルである上記〔1〕記載のアクリロニトリル化合物。

【0015】〔3〕 R¹はメチルまたはノルマルヘキシルであり、R³はメチルであり、R⁴はH、塩素原子、メチルまたはメトキシであり、R⁵はH、メチルまたはエチルであり、Rfはターシャリーブチルである上記〔2〕記載のアクリロニトリル化合物。

【0016】〔4〕 Alはフェニルであり、R¹はC₁~C₆アルキルであり、R²はHまたはC(O)Rfであり、R³はC₁~C₆アルキルであり、R⁴はH、ハロゲンまたはC₁~C₆アルキルであり、R⁵はHまたはC₁~C₆アルキルであり、RfはC₁~C₆アルキルである上記〔1〕記載のアクリロニトリル化合物。

【0017】〔5〕 R¹はメチルまたはノルマルヘキシルであり、R³はメチルであり、R⁴はH、塩素原子またはメチルであり、R⁵はHまたはメチルであり、Rfはターシャリーブチルである上記〔4〕記載のアクリロニトリル化合物。

【0018】〔6〕上記〔1〕~〔5〕記載のアクリロニトリル化合物の1種以上を有効成分として含有することを特徴とする農薬。

【0019】

【発明の実施の形態】本発明化合物(1)の-C(C₁N)=C(OR²)-部は、R²が水素原子以外の場合にE体及びZ体の2種の異性体が存在するが、両者とも本発明に含まれる。また、R²が水素原子の場合には互変異性体が存在するが、これらも本発明に含まれる。

【0020】次にA、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、X、Ra、Rb、Rc、Rd、Re、Rf、Rg、Rh、Ri、Rj、Rk、T¹、T²、T³、U¹及びU²の好ましい範囲を説明する。

【0021】好ましいAの範囲は以下に示す群である。即ち、AI：C₁~C₆アルキル、Xで置換されていてもよいフェニル、ナフチルまたはピリジニル。AII：C₁~C₆アルキル、Xで置換されていてもよいフェニル。

【0022】好ましいR¹の範囲は以下に示す群である。R¹I：H、C₁~C₁₂アルキル、C₂~C₁₂アルキルスルフェニルアルキル、C₂~C₁₂アルコキシアルキル、フェニルで置換されたC₁~C₃アルキル。R¹II：H、C₁~C₁₂アルキル。

【0023】好ましいR²の範囲は以下に示す群である。R²I：H、C₁~C₄アルキル、C₂~C₄アルコキシアルキル、CH₂OC₂H₄OCH₃、SO₂Re、SO₂NHRb、SO₂NRaRb、C(S)NHRb、C(S)NRaRb、CH₂CO₂Ra、C(O)Rf、アルカリ金属、アルカリ土類金属、NHRiRjRk。R²II：H、C₁~C₄アルキル、C₂

～C₄アルコキシアルキル、SO₂Re、C(O)Rf、アルカリ金属、アルカリ土類金属、NHRiRjRk、R²III：H、C₁～C₄アルキル、C₂～C₄アルコキシアルキル、SO₂Re、C(O)Rf。

【0024】好ましいR³の範囲は以下に示す群である。R³I：C₁～C₄アルキル、C₁～C₄アルコキシアルキル、R³II：C₁～C₄アルキル。

【0025】好ましいR⁴の範囲は以下に示す群である。R⁴I：H、OH、SH、NH₂、ハロゲン、C₁～C₄アルキル、C₁～C₄アルコキシ、C₁～C₄ハロアルコキシ、C₁～C₄アルコキシアルキル、R⁴II：H、OH、ハロゲン、C₁～C₄アルキル。

【0026】好ましいR⁵の範囲は以下に示す群である。R⁵I：H、OH、SH、NH₂、ハロゲン、C₁～C₄アルキル、C₁～C₄アルコキシ、C₁～C₄ハロアルコキシ、C₁～C₄アルコキシアルキル、R⁵II：H、OH、ハロゲン、C₁～C₄アルキル。

【0027】好ましいXの範囲は以下に示す群である。即ち、XI：ハロゲン、C₁～C₄アルキル、C₁～C₄ハロアルキル、C₁～C₄アルコキシ及びフェニルの中から任意に選ばれる1ないし3個の置換基。XII：ハロゲン、C₁～C₄アルキル、C₁～C₄ハロアルキル、C₁～C₄アルコキシ及びフェニルの中から任意に選ばれる1ないし2個の置換基。

【0028】好ましいRaの範囲は以下に示す群である。即ち、RaI：C₁～C₄アルキル。

【0029】好ましいRbの範囲は以下に示す群である。即ち、RbI：C₁～C₆アルキル、T¹で置換されていてもよいフェニル。

【0030】好ましいRcの範囲は以下に示す群である。即ち、RcI：ハロゲン、C₁～C₄アルキル、C₁～C₄アルコキシで置換されていてもよいフェニル。

【0031】好ましい、Rdの範囲は以下に示す群である。即ち、RdI：ハロゲン、C₁～C₄アルキルで置換されていてもよいベンゾイル。

【0032】好ましいReの範囲は以下に示す群である。即ち、ReI：C₁～C₄アルキル、T¹で置換されていてもよいフェニル。

【0033】好ましいRfの範囲は以下に示す群である。即ち、RfI：C₁～C₆アルキル、C₂～C₆アルケニル、C₁～C₆ハロアルキル、C₂～C₄アルコキシアルキル、C₁～C₃アルキルで置換されていてもよいC₃～C₆シクロアルキル、C₁～C₆アルコキシ、C₃～C₆シクロアルコキシ、T³で置換されていてもよいフェニル。RfII：C₁～C₆アルキル、C₁～C₃アルキルで置換されていてもよいC₃～C₆シクロアルキル、C₁～C₆アルコキシ、T³で置換されていてもよいフェニル。

【0034】好ましいRgの範囲は以下に示す群である。即ち、RgI：OH、C₁～C₆アルコキシまたはC₁～C₄アルキルスルフェニル。

【0035】好ましいRhの範囲は以下に示す群である。

即ち、RhI：C₁～C₆アルコキシ、C₁～C₄アルキルスルフェニル。

【0036】好ましいRiの範囲は以下に示す群である。即ち、RiI：H、C₁～C₆アルキル、C₃～C₆シクロアルキルまたはベンジルであるか、あるいはRiとRjが、それぞれが結合している窒素原子と共に酸素原子、窒素原子もしくは硫黄原子を含有していてもよい5ないし6員環基を形成してもよい。

【0037】好ましいRjの範囲は以下に示す群である。即ち、RjI：H、C₁～C₆アルキル、C₃～C₆シクロアルキルまたはベンジルであるか、あるいはRiとRjが、それぞれが結合している窒素原子と共に酸素原子、窒素原子もしくは硫黄原子を含有していてもよい5ないし6員環基を形成してもよい。

【0038】好ましいRkの範囲は以下に示す群である。即ち、RkI：H、C₁～C₆アルキル。

【0039】好ましいU¹の範囲は以下に示す群である。即ち、U¹I：H、C₁～C₆アルキル、COORa、フェニルまたはベンジル。

【0040】好ましいU²の範囲は以下に示す群である。即ち、U²I：H、C₁～C₆アルキル、COORa、フェニルまたはベンジル。

【0041】好ましいT¹の範囲は以下に示す群である。即ち、T¹I：ハロゲン、C₁～C₄アルキル、C₁～C₄ハロアルキル。

【0042】好ましいT³の範囲は以下に示す群である。即ち、T³I：ハロゲン、C₁～C₄アルキル、C₁～C₄ハロアルキル、C₁～C₄アルコキシ、C₁～C₄ハロアルコキシ、C₁～C₄アルキルスルフェニル、C₁～C₄アルキルスルフィニル、C₁～C₄アルキルスルフォニル、-N^UU²の中から任意に選ばれる1ないし3個の置換基。T³II：ハロゲン、C₁～C₄アルキル、C₁～C₄ハロアルキル、C₁～C₄アルコキシの中から任意に選ばれる1ないし3個の置換基。

【0043】上述の好ましい置換基の範囲における各群はそれぞれ任意に組み合わせる事ができる。

【0044】次にA、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、X、Ra、Rb、Rc、Rd、Re、Rf、Rg、Rh、Ri、Rj、Rk、T¹、T²、T³、U¹及びU²の定義における各原子および基の例を示す。

【0045】R⁴、R⁵、X、Rc、Rd、T¹、T²及びT³の定義におけるハロゲン原子としては、フッ素原子、塩素原子、臭素原子及びヨウ素原子があげられ、好ましくはフッ素原子、塩素原子及び臭素原子があげられる。

【0046】A、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、X、Ra、Rb、Rc、Rd、Re、Rf、Rg、Rh、Ri、Rj、Rk、T¹、T³、U¹及びU²の定義におけるアルキルとしては、直鎖または分岐状のアルキルとしてメチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、イソブチル、tert-ブチル、sec-ブチル、ペンチル-1、ペンチル-2、ペンチル-3、2-メチルブチル-1、2-メチルブチル-2、2-メチルブチル-3、3-メチルブチル-1、2,2-ジメチルプロピル-1、ヘキシル-1、ヘ

キシル-2、ヘキシル-3、1-メチルベンチル、2-メチルベンチル、3-メチルベンチル、4-メチルベンチル、1,1-ジメチルブチル、1,2-ジメチルブチル、1,3-ジメチルブチル、2,2-ジメチルブチル、2,3-ジメチルブチル、3,3-ジメチルブチル、1-エチルブチル、2-エチルブチル、1,1,2-トリメチルプロピル、1,2,2-トリメチルプロピル、1-エチル-1-メチルプロピル及び1-エチル-2-メチルプロピル等があげられ、各々の指定の炭素数の範囲で選択される。

【0047】A、R¹、R³、R⁴、R⁵、X、Rc、Rd、Re、Rf、T¹及びT³の定義におけるハロアルキルとしては、直鎖または分岐状のハロアルキルとしてフルオロメチル、クロロメチル、ブロモメチル、フルオロエチル、クロロエチル、ブロモエチル、フルオロ-n-プロピル、クロロ-n-プロピル、ジフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、トリフルオロメチル、ジクロロメチル、トリクロロメチル、ジフルオロエチル、トリフルオロエチル、トリクロロエチル、クロロジフルオロメチル、ブロモジフルオロメチル、トリフルオロクロロエチル、ヘキサフルオロ-n-プロピル、クロロブチル及びフルオロブチル等があげられ、各々の指定の炭素数の範囲から選択される。

【0048】A、R¹、Rf、Ri、Rj及びRkの定義におけるシクロアルキルとしては、シクロプロピル、1-メチルシクロプロピル、2,2,3,3-テトラメチルシクロプロピル、シクロブチル、1-エチルシクロブチル、1-n-ブチルシクロブチル、シクロペンチル、1-メチルシクロペンチル、シクロヘキシル、1-メチルシクロヘキシル及び4-メチルシクロヘキシル、シクロヘプチル等があげられる。

【0049】Rfの定義におけるRcで置換されたC₁~C₄アルキルとしては、ベンジル、2-クロロベンジル、3-プロモベンジル、4-クロロベンジル、4-メチルベンジル、4-tert-ブチルベンジル、2-メチルベンジル、2-メトキシベンジル、1-フェニルエチル、1-(3-クロロフェニル)エチル、2-フェニルエチル、1-メチル-1-フェニルエチル、1-(4-クロロフェニル)-1-メチルエチル、1-(3-クロロフェニル)-1-メチルエチル、1-フェニルプロピル、2-フェニルプロピル、3-フェニルプロピル、1-フェニルブチル、2-フェニルブチル、3-フェニルブチル、4-フェニルブチル、1-メチル-1-フェニルプロピル、1-メチル-2-フェニルプロピル、1-メチル-3-フェニルプロピル、2-メチル-2-フェニルプロピル、2-(4-クロロフェニル)-2-メチルプロピル及び2-メチル-2-(3-メチルフェニル)-プロピル等があげられる。

【0050】Rb及びReの定義におけるT¹で置換されていてもよいフェニルとしては、フェニル、2-フルオロフェニル、3-フルオロフェニル、4-フルオロフェニル、2-クロロフェニル、3-クロロフェニル、4-クロロフェニル、2-ブロモフェニル、3-ブロモフェニル、4-ブロモフェニル、4-ヨードフェニル、2,4-ジクロロフェニル、3,4-ジクロロフェニル、2,6-ジフルオロフェニル、2,6-ジクロ

ロフェニル、2-フルオロ-4-クロロフェニル、2,3,4,5,6-ペンタフルオロフェニル、2-メチルフェニル、3-メチルフェニル、4-メチルフェニル、2,5-ジメチルフェニル、4-メチル-2,3,5,6-テトラフルオロフェニル、2-メトキシフェニル、3-メトキシフェニル、4-メトキシフェニル、2,6-メトキシフェニル、3,4-ジメトキシフェニル及び3,4,5-トリメトキシフェニル、2-トリフルオロメチルフェニル、3-トリフルオロメチルフェニル、4-トリフルオロメチルフェニル等があげられる。

【0051】R⁴、R⁵、X、Rc、Rd、Rf、Rg、Rh、T¹及びT³の定義におけるアルコキシとしては、直鎖または分岐鎖状のアルコキシとしてメトキシ、エトキシ、n-プロポキシ、イソプロポキシ、n-ブトキシ、イソブトキシ、sec-ブトキシ、tert-ブトキシ、n-ペンチルオキシ、1-メチルブチルオキシ、2-メチルブチルオキシ、3-メチルブチルオキシ、1,1-ジメチルプロポキシ、1,2-ジメチルプロポキシ、2,2-ジメチルプロポキシ、1-エチルプロピルオキシ、n-ヘキシルオキシ、1-メチルベンチルオキシ、2-メチルベンチルオキシ、3-メチルベンチルオキシ、4-メチルベンチルオキシ、1,1-ジメチルブチルオキシ、1,2-ジメチルブチルオキシ、1,3-ジメチルブチルオキシ、2,2-ジメチルブチルオキシ基、2,3-ジメチルブチルオキシ基、3,3-ジメチルブチルオキシ、1-エチルブチルオキシ、2-エチルブチルオキシ、1,1,2-トリメチルプロピルオキシ、1,2,2-トリメチルプロピルオキシ、1-エチル-1-メチルプロピルオキシ及び1-エチル-2-メチルプロピルオキシ等があげられ、各々の指定の炭素数の範囲から選択される。

【0052】Rf及びT³の定義における-NH-U²としてはメチルアミノ、エチルアミノ、n-プロピルアミノ、イソプロピルアミノ、n-ブチルアミノ、イソブチルアミノ、sec-ブチルアミノ、tert-ブチルアミノ、n-ペンチルアミノ、1-メチルブチルアミノ、2-メチルブチルアミノ、3-メチルブチルアミノ、1,1-ジメチルプロピルアミノ、1,2-ジメチルプロピルアミノ、2,2-ジメチルプロピルアミノ、1-エチルプロピルアミノ、n-ヘキシルアミノ、1-メチルベンチルアミノ、2-メチルベンチルアミノ、3-メチルベンチルアミノ、4-メチルベンチルアミノ、1,1-ジメチルブチルアミノ、1,2-ジメチルブチルアミノ、1,3-ジメチルブチルアミノ、2,2-ジメチルブチルアミノ、2,3-ジメチルブチルアミノ、3,3-ジメチルブチルアミノ、1-エチルブチルアミノ、2-エチルブチルアミノ、1,1,2-トリメチルプロピルアミノ、1,2,2-トリメチルプロピルアミノ、1-エチル-1-メチルプロピルアミノ、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、ジ-n-プロピルアミノ、ジイソプロピルアミノ、ジ-n-ブチルアミノ、ジ-sec-ブチルアミノ、ジイソブチルアミノ、ジ-n-ペンチルアミノ、ジ-n-ヘキシルアミノ、メチルエチルアミノ、メチルプロピルアミノ、メチルイソプロピルアミノ、メチルブチルアミノ、メチル-sec-ブチルアミノ、メチルイソブチ

ルアミノ、メチル-tert-ブチルアミノ、メチルベンチルアミノ、メチルヘキシルアミノ、エチルプロピルアミノ、エチルイソプロピルアミノ、エチルブチルアミノ、エチルsec-ブチルアミノ、エチルイソブチルアミノ、エチルベンチルアミノ、エチルヘキシルアミノ、フェニルアミノ、ベンジルアミノ、N-メチルアセトアミド、N-エチルアセトアミド及びN-フェニルアセトアミドN-アセチルアセトアミド等があげられ、各々の指定の炭素数の範囲で選択される。

【0053】R⁴、R⁵、X、R_c、R_d、R_f及びT³の定義におけるハロアルコキシとしては、各々直鎖状または分岐鎖状のハロアルコキシがあげられ、フルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、ブromoジフルオロメトキシ、ジクロロフルオロメトキシ、クロロメトキシ、ジクロロメトキシ、トリクロロメトキシ、ブromoメトキシ、フルオロエトキシ、クロロエトキシ、ブromoエトキシ、ジフルオロエトキシ、トリフルオロエトキシ、テトラフルオロエトキシ、ペンタフルオロエトキシ、トリクロロエトキシ、トリフルオロクロロエトキシ、フルオロブropoxy、クロロブropoxy、ブromoブropoxy、フルオロブトキシ、クロロブトキシ、フルオロ-iso-ブropoxy及びクロロ-iso-ブropoxy等があげられる。

【0054】R¹、R⁴、R⁵、X、R_g、R_h及びT³の定義におけるアルキルスルフェニルとしては、メチルチオ、エチルチオ、n-プロピルチオ、iso-プロピルチオ、n-ブチルチオ、iso-ブチルチオ、sec-ブチルチオ及びtert-ブチルチオ等があげられる。

【0055】R¹、R⁴、R⁵、X及びT³の定義におけるアルキルスルフィニルとしては、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、n-プロピルスルフィニル、iso-プロピルスルフィニル、n-ブチルスルフィニル、iso-ブチルスルフィニル、sec-ブチルスルフィニル及びtert-ブチルスルフィニル等があげられる。

【0056】R¹、R⁴、R⁵、X及びT³の定義におけるアルキルスルフォニルとしては、メチルスルフォニル、エチルスルフォニル、n-プロピルスルフォニル、iso-プロピルスルフォニル、n-ブチルスルフォニル、iso-ブチルスルフォニル、sec-ブチルスルフォニル及びtert-ブチルスルフォニル等があげられる。

【0057】R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、X、R_c、R_d及びR_fの定義におけるアルコシアルキルとしては、メトキシメチル、エトキシメチル、n-プロポキシメチル、iso-プロポキシメチル、n-ブトキシメチル、iso-ブトキシメチル、sec-ブトキシメチル、tert-ブトキシメチル、n-ベンチルオキシメチル、メトキシエチル、エトキシメチル及びメトキシプロピル等があげられ、各々指定の炭素数の範囲から選択される。

【0058】A及びR_fの定義におけるナフチルとしては1-ナフチル及び2-ナフチルがあげられる。

【0059】R²の定義におけるT¹で置換されていてもよいピリジニルとしては、T¹で置換されていてもよい2-ピリジニル、T¹で置換されていてもよい3-ピリジニル及びT¹で置換されていてもよい4-ピリジニルがあげられ、好ましくはT¹で置換されていてもよい2-ピリジニル及びT¹で置換されていてもよい3-ピリジニルである。

【0060】R⁴、R⁵、X及びT³の定義におけるハロアルキルスルフェニルとしては、直鎖状または分岐鎖状のハロアルキルチオとしてフルオロメチルチオ、クロロジフルオロメチルチオ、ブromoジフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ、トリクロロメチルチオ、2,2,2-トリフルオロエチルチオ、1,1,2,2-テトラフルオロエチルチオ、フルオロエチルチオ、ペンタフルオロエチルチオ及びフルオロ-iso-プロピルチオ基等があげられる。

【0061】R⁴、R⁵、X及びT³の定義におけるハロアルキルスルフィニルとしては、直鎖状または分岐鎖状のハロアルキルスルフィニルとしてフルオロメチルスルフィニル、クロロジフルオロメチルスルフィニル、ブromoジフルオロメチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルフィニル、トリクロロメチルスルフィニル、2,2,2-トリフルオロエチルスルフィニル、1,1,2,2-テトラフルオロエチルスルフィニル、フルオロエチルスルフィニル、ペンタフルオロエチルスルフィニル及びフルオロ-iso-プロピルスルフィニルなどがあげられる。

【0062】R⁴、R⁵、X及びT³の定義におけるハロアルキルスルフォニルとしては、直鎖状または分岐鎖状のハロアルキルスルフォニルとしてフルオロメチルスルフォニル、クロロジフルオロメチルスルフォニル、ブromoジフルオロメチルスルフォニル、トリフルオロメチルスルフォニル、トリクロロメチルスルフォニル、2,2,2-トリフルオロエチルスルフォニル、1,1,2,2-テトラフルオロエチルスルフォニル、フルオロエチルスルフォニル、ペンタフルオロエチルスルフォニル及びフルオロ-iso-プロピルスルフォニル等があげられる。

【0063】R_f、R_i、R_j、R_kの定義におけるアルケニルオキシとしては、C₂~C₄直鎖または分岐状のアルケニルオキシとしてアリルオキシ、2-プロペニルオキシ、2-ブテニルオキシ及び2-メチル-2-プロペニルオキシ等があげられる。

【0064】A、R¹、X、R³、R⁴、R⁵、R_i、R_j及びR_kの定義におけるアルケニルとしては、アリル、2-プロペニル、2-ブテニル、2-メチル-2-プロペニル、4-メチル-3-ペンテニル、2-ヘキセニル等があげられ、各々指定の炭素数で選択される。

【0065】R²の定義におけるアルカリ金属としてはリチウム、ナトリウム、カリウムがあげられる。

【0066】R²の定義におけるアルカリ土類金属としては、マグネシウム、カルシウム、ストロンチウムまたはバリウムがあげられ、好ましくはマグネシウム、カルシ

ウムまたはバリウムがあげられる。

【0067】R²の定義におけるNHR¹R²JR³Kで示されるアンモニウム基としては、アンモニウム基、モノメチルアンモニウム基、ジメチルアンモニウム基、トリメチルアンモニウム基、ジエチルアンモニウム基、トリエチルアンモニウム基、ジイソプロピルアンモニウム基、ジイソプロピルエチルアンモニウム基、ヘキシルメチルアンモニウム基、シクロプロピルメチルアンモニウム基、シクロヘキシルメチルアンモニウム基、アリルメチルアンモニウム基、ベンジルメチルアンモニウム基または4-メチルシクロヘキシルエチルアンモニウム基であるか、あるいはR¹、R²及びR³のうちの2個がそれぞれが結合している窒素原子とともに酸素原子、窒素原子もしくは硫黄原子を含有してよい複素環式5員環、6員環、7員環または8員環アンモニウム基等があげられる。

【0068】R¹、R²及びR³の定義におけるR¹、R²及びR³のうちの2個がそれぞれが結合している窒素原子とともに酸素原子、窒素原子もしくは硫黄原子を含有していてもよい複素環式5ないし8員環アンモニウム基としては、ピロリジン、ピラゾリジン、イミダゾリジン、オキサゾリジン、イソオキサゾリジン、チアゾリジン、ピペリジン、ピペラジン、モルホリン、チアモルホリン、ヘキサメチレンイミン、ヘプタメチレンイミンがあげられる。

【0069】U¹及びU²の定義におけるU¹とU²とが結合している窒素原子とともに酸素原子、窒素原子もしくは硫黄原子を含有していてもよい複素環式5ないし8員環としては、ピロリジン、ピラゾリジン、イミダゾリジン、オキサゾリジン、イソオキサゾリジン、チアゾリジン、ピペリジン、ピペラジン、モルホリン、チアモルホリン、ヘキサメチレンイミン、ヘプタメチレンイミンがあげられる。

【0070】R⁴の定義におけるC₃～C₆ハロシクロアルキルとしては、フルオロシクロプロピル、ジフルオロシクロプロピル、クロロシクロプロピル、ジクロロシクロプロピル、1-メチル-2,2-ジクロロシクロプロピル、クロロシクロブチル、ジクロロシクロブチル、クロロシクロペンチル、ジクロロシクロペンチル、クロロシクロヘキシル、ジクロロシクロヘキシル、テトラフルオロシクロブチルなどがあげられる。

【0071】R⁴の定義におけるT²及びC₁～C₄アルキルで置換されたシクロプロピルとしては、2,2-ジメチル-3-(2,2-ジメチルエチル)-シクロプロピル、3-(2,2-ジプロモエチル)-2,2-ジメチルシクロプロピル、3-(2,2-ジクロロエチル)-2,2-ジメチルシクロプロピル、3-(2,2-クロロトリフルオロエチル)-2,2-ジメチルシクロプロピル等があげられる。

【0072】R⁴の定義におけるC₁～C₄アルキルで置換されていてもよいC₃～C₆シクロアルコキシ基としては、シクロプロポキシ基、シクロブトキシ基、シクロペントキ

シ基、シクロヘキシルオキシ基、1-メチルシクロプロピキシ基等があげられる。

【0073】R⁴の定義におけるR^c及びハロゲン原子で置換されたC₃～C₆シクロアルキルとしては、2,2-ジクロロ-1-フェニルシクロプロピル、2,2-ジクロロ-1-(3-クロロフェニル)-シクロプロピル、2,2-ジクロロ-1-(4-メトキシフェニル)-シクロプロピル、2,2-ジクロロ-1-(4-エトキシフェニル)-シクロプロピル、2,2-ジクロロ-1-(4-iso-プロピルオキシフェニル)-シクロプロピル、2,2-ジクロロ-1-(4-tert-ブチルフェニル)-シクロプロピル、2,2-ジクロロ-1-(4-メトキシフェニル)-3-フェニルシクロプロピル、1-(4-エトキシフェニル)-2,2,3,3-テトラフルオロブチル等があげられる。

【0074】R⁴の定義におけるR^cと炭素数1～4のアルキル基で置換されたシクロプロピル基としては、2,2-ジメチル-1-フェニルシクロプロピル基、1-(4-クロロフェニル)-2,2-ジメチルシクロプロピル基、2,2-ジメチル-3-フェニルシクロプロピル基、3-(3-クロロフェニル)-2,2-ジメチルシクロプロピル基、(4-クロロフェニル)-2,2-ジメチル-3-フェニルシクロプロピル基、(4-プロモフェニル)-2,2-ジメチル-3-フェニルシクロプロピル基、2,2-ジメチル-3-(4-メチルフェニル)-シクロプロピル基、(4-tert-ブチルフェニル)-2,2-ジメチル-3-フェニルシクロプロピル基等があげられる。

【0075】R⁴の定義におけるR^cで置換されたC₃～C₆シクロアルキルとしては、1-フェニルシクロプロピル、1-(3-クロロフェニル)-シクロプロピル、1-(4-クロロフェニル)-シクロプロピル、1-(4-プロモフェニル)-シクロプロピル、1-(4-フルオロフェニル)-シクロプロピル、1-(4-エチルフェニル)-シクロプロピル、1-(4-プロピルフェニル)-シクロプロピル、2-フェニルシクロプロピル、1-フェニルシクロブチル、2-フェニルシクロブチル、1-フェニルシクロペンチル、1-(4-クロロフェニル)-シクロペンチル、2-フェニルシクロペンチル、3-フェニルシクロペンチル、1-フェニルシクロヘキシル、1-(3-フルオロフェニル)-シクロヘキシル、1-(4-クロロフェニル)-シクロヘキシル、1-(4-tert-ブチルフェニル)-シクロヘキシル、2-フェニルシクロヘキシル、3-フェニルシクロヘキシル、4-フェニルシクロヘキシル等があげられる。

【0076】本発明化合物は、農園芸作物及び樹木などを加害するいわゆる農業害虫、家畜家禽類に寄生するいわゆる家畜害虫、家屋等の人間の生活環境で様々な悪影響を与えるいわゆる衛生害虫、倉庫に貯蔵された穀物等を加害するいわゆる貯蔵害虫、及び同様の場面で発生加害するダニ類、線虫類、軟体動物、甲殻類のいずれの害虫も低濃度で有効に防除できる。

【0077】本発明化合物を用いて防除しうる昆虫類、ダニ類、線虫類、軟体動物及び甲殻類には具体的には次に示すものがあるが、それらのみに限定されるものでは

ない。

【0078】ニカメイガ、コブノメイガ、フタオビコヤガ、イチモンジセセリ、コナガ、ヨトウガ、モンシロチョウ、カブラヤガ、ハスモンヨトウ、シロイチモンジヨトウ、チャノコカクモンハマキ、チャハマキ、モモシנקイ、ナシヒメシנקイ、リンゴコカクモンハマキ、キンモンホソガ、コットンボールワーム、タバコバッドワーム、ヨーロピアンコーンボラー、フォールアーミーワーム、コドリング及びアメリカシロヒトリなどの鱗翅目害虫、ツマグロヨコバイ、トビイロウンカ、モモアカアブラムシ、ワタアブラムシ、オンシツコナジラミ、タバココナジラミ、ナシキジラミ、ツツジグンバイ、ヤノネカイガラムシ、クワコナカイガラムシ、ルビーロウムシ、クサギカメムシ、ナガメ及びナンキンムシなどの半翅目害虫、ニジュウヤホシテントウ、ドウガネブイブイ、イネミズゾウムシ、アリモドキゾウムシ、ウリハムシ、キスジノミハムシ、コロラドハムシ、ゴマダラカミキリ、マツノマダラカミキリ、コーンルートワーム、コクゾウ、グラナリーウィービル及びコクヌストモドキなどの鞘翅目害虫、

【0079】マメハモグリバエ、タネバエ、ヘシアンフライ、ウリミバエ、チチュウカイミバエ、イエバエ、サシバエ、ヒツジシラミバエ、キスジウシバエ、ウシバエ、ヒツジバエ、ツエツツエバエ、アカイエカ、ネッタイシマカ及びハマダラカなどの双翅目害虫、カブラハバチ、マツノキハバチ及びクリハバチなどの膜翅目害虫、ミナミキイロアザミウマ、ネギアザミウマ、ミカンキイロアザミウマ、ヒラズハナアザミウマ及びチャノキイロアザミウマなどの総翅目害虫、クロゴキブリ、ヤマトゴキブリ及びチャバネゴキブリなどの網翅目害虫、トノサマバッタ、コバネイナゴ及びサバクワタリバッタなどの直翅目害虫、イエシロアリ、ヤマトシロアリ及びタイワンシロアリなどのシロアリ目害虫、ネコノミ、ヒトノミ及びケオプスネズミノミなどの等翅目害虫、ニワトリオオハジラミ及びウシハジラミなどのハジラミ目害虫、ウシジラミ、ブタジラミ、ウシホソジラミ及びケブカウシジラミなどのシラミ目害虫、ミカンハダニ、リンゴハダニ、ナミハダニ及びカンザワハダニなどのハダニ類、

【0080】ミカンサビダニ、ニセナシサビダニ、チェーリップサビダニ及びチャノナガサビダニなどのフシダニ類、チャノホコリダニ及びシクラメンホコリダニなどのホコリダニ類、ケナガコナダニ及びロビンネダニなどのコナダニ類、ミツバチヘギイタダニなどのハチダニ類、オウシマダニ及びフタトゲチマダニなどのキュウセンダニ類、ヒゼンダニなどのヒゼンダニ類、サツマイモネコブセンチュウ、キタネコブセンチュウ、キタネグサレセンチュウ、クルミネグサレセンチュウ、ジャガイモシストセンチュウ及びマツノザイセンチュウなどの線虫類、スクミリンゴガイ、ナメクジ、ウスカワマイマイ及びミスジマイマイなどの軟体動物、オカダンゴムシなど

の甲殻類などがあげられる。

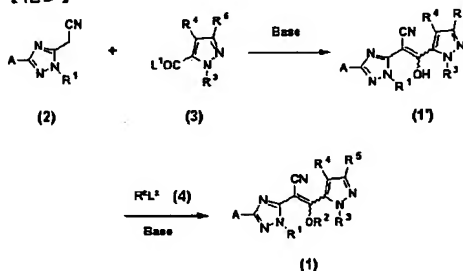
【0081】すなわち、本発明化合物は直翅目、半翅目、鱗翅目、鞘翅目、膜翅目、双翅目、シロアリ目及びダニ・シラミ類の害虫や植物病害を低濃度で有効に防除できる。一方、本発明化合物は哺乳類、魚類、甲殻類及び益虫に対してほとんど悪影響がない極めて有用な化合物を含む。

【0082】本発明化合物(1)は、スキーム1に記載した方法によって合成できる。即ち本発明化合物(1)は、一般式(2)で表されるシアノメチルトリアゾール誘導体と一般式(3)で表されるカルボン酸誘導体とを塩基存在下で反応させることにより本発明化合物の一部を合成することができ、更にこれを一般式(4)で表される化合物と反応させることにより本発明化合物が得られることを表す。一般式(4)で表される化合物は、具体的にはアシルハライド類、ベンゾイルハライド類、アルキルハライド類、ベンジルハライド類、アルコキシアルキルハライド類、アルコシアルコシアルキルハライド類、フェノキシアルキルハライド類、ベンジルオキシアルキルハライド類、アルキルスルフォネート類、ベンゼンスルフォネート類、トルエンスルフォネート類、 α -ハロケトン類及び α -ハロエステル類等である。

【スキーム1】

【0083】

【化3】



【0084】【スキーム1中のA、R¹、R²、R³、R⁴及びR⁵は前記と同じ意味を表し、L¹及びL²は良好な脱離基、例えば塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、C₁~C₄アルキルスルフォニルオキシ、ベンゼンスルフォニルオキシ、トルエンスルフォニルオキシ、1-イミダゾリル及び1-ピラゾリル等である。】

【0085】上記に記載した方法は塩基を用いたほうが好ましい場合もある。用いられる塩基としてはナトリウムエトキシド、ナトリウムメトキシド及びtert-ブトキシカリウム等のアルカリ金属アルコキシド類、水酸化ナトリウム及び水酸化カリウム等のアルカリ金属水酸化物、炭酸ナトリウム及び炭酸カリウム等のアルカリ金属炭酸塩、トリエチルアミン、ピリジン及びDBU等の有機塩基、ブチルリチウム等の有機リチウム化合物、リチウムジイソプロポピルアミド及びリチウムビストリメチ

ルシリルアミド等のリチウムアミド類並びに水素化ナトリウム等が挙げられる。

【0086】上記に記載した反応は、反応に不活性な溶媒中で行う事ができ、溶媒としてはメタノール及びエタノール等の低級アルコール類、ベンゼン及びトルエン等の芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、1,4-ジオキサン、1,2-ジメトキシエタン及び1,2-ジエトキシエタン等のエーテル類、アセトン、メチルエチルケトン及びメチルイソブチルケトン等のケトン類、塩化メチレン、クロロホルム及び1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド及び1,3-ジメチルイミダゾリジノン等のアミド類、アセトニトリル等のニトリル類、ジメチルスルホキシド並びにこれらの混合溶媒等が挙げられる。場合によっては、これらの溶媒と水との混合溶媒も用いる事ができ、テトラ-n-ブチルアンモニウムブロマイド等の4級アンモニウム塩を触媒として添加する事により好結果が得られる場合もある。反応温度は-70℃から200℃の任意の温度に設定する事が可能であり、0℃から150℃または溶媒を用いる場合には-70℃から溶媒の沸点の範囲が好ましい。塩基は反応基質の0.05から10当量を、好ましくは0.05から3当量の範囲である。

【0087】本発明化合物は常法により反応液から得ることができるが、本発明化合物を精製する必要がある場合には再結晶、カラムクロマトグラフィー等の任意の精製法によって分離、精製することができる。

【0088】なお、本発明に包含される化合物の中で不斉炭素を有する化合物の場合には、光学活性な化合物(+)体及び(-)体が含まれる。

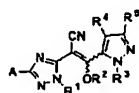
【0089】本発明に含まれる化合物の例を第1表に示す。尚、表中の略号はそれぞれ以下の意味を示す。

【0090】Me:メチル基、Et:エチル基、Pr:プロピル基、Bu:ブチル基、Pen:ペンチル基、Hex:ヘキシル基、Hep:ヘプチル基、Oct:オクチル基、Non:ノニル基、Dec:デシル基、Ph:フェニル基、n:ノルマル、i:イソ、s:セカンダリー、t:ターシャリー、c:シクロ。

【0091】〔第1表〕

【0092】

【化4】



【0093】

【表1】

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
Ph	Me	H	Me	H	H
Ph	Me	H	Me	Me	Cl
Ph	Me	H	Me	Et	Cl
Ph	Me	H	Me	Me	OMe
Ph	Me	H	Me	Et	OMe
Ph	Me	H	Me	OMe	Et
Ph	Me	H	Me	Me	Et
Ph	Me	H	Me	Et	Me
Ph	Me	H	Me	Me	Me
Ph	Me	H	Me	Me	CF ₃
Ph	Me	H	Me	H	CF ₃
Ph	Me	H	Me	CF ₃	Me
Ph	Me	H	Me	Me	CF ₃
Ph	Me	H	Me	CF ₃	Me
Ph	Me	CO ₂ Bu	Me	Cl	Cl
Ph	Me	CO ₂ Bu	Me	H	H
Ph	Me	CO ₂ Bu	Me	Me	Cl
Ph	Me	CO ₂ Bu	Me	Et	Cl
Ph	Me	CO ₂ Bu	Me	Me	OMe
Ph	Me	CO ₂ Bu	Me	Et	OMe
Ph	Me	CO ₂ Bu	Me	OMe	Et
Ph	Me	CO ₂ Bu	Me	Me	Et
Ph	Me	CO ₂ Bu	Me	Et	Me
Ph	Me	CO ₂ Bu	Me	CF ₃	H

【0094】

【表2】

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
Ph	Me	CO ₂ Bu	Me	H	CF ₃
Ph	Me	CO ₂ Bu	Me	CF ₃	Me
Ph	Me	CO ₂ Bu	Me	Me	CF ₃
Ph	Me	CO ₂ Bu	Me	CF ₃	Me
Me	Me	CO ₂ Bu	Me	Cl	Cl
Me	Me	CO ₂ Bu	Me	Me	Me
Et	Me	CO ₂ Bu	Me	Me	Cl
Et	Me	CO ₂ Bu	Me	Me	Me
nPr	Me	CO ₂ Bu	Me	Me	Cl
nPr	Me	CO ₂ Bu	Me	Me	Me
iPr	Me	CO ₂ Bu	Me	Me	Cl
iPr	Me	CO ₂ Bu	Me	Me	Me
nBu	Me	CO ₂ Bu	Me	Me	Cl
nBu	Me	CO ₂ Bu	Me	Me	Me
iBu	Me	CO ₂ Bu	Me	Me	Cl
iBu	Me	CO ₂ Bu	Me	Me	Me
sBu	Me	CO ₂ Bu	Me	Me	Cl
sBu	Me	CO ₂ Bu	Me	Me	Me
tBu	Me	CO ₂ Bu	Me	Me	Cl
tBu	Me	CO ₂ Bu	Me	Me	Me
Ph	Et	CO ₂ Bu	Me	Me	Me
Ph	nPr	CO ₂ Bu	Me	Me	Me
Ph	iPr	CO ₂ Bu	Me	Me	Me

【0095】

【表3】

A	R'	R''	R'''	R''''	R'''''
Ph	nBu	COtBu	Me	Me	Me
Ph	iBu	COtBu	Me	Me	Me
Ph	sBu	COtBu	Me	Me	Me
Ph	tBu	COtBu	Me	Me	Me
Ph	nPen	COtBu	Me	Me	Me
Ph	nOct	COtBu	Me	Me	Me
Ph	nDod	COtBu	Me	Me	Me
Ph	nDec	COtBu	Me	Me	Me
Ph	nPen	COtBu	Me	Me	Me
Ph	nPen	COtBu	Me	Me	Me
Ph	nHex	COtBu	Me	Me	Me
Ph	nHept	COtBu	Me	Me	Me
Ph	Me	COtBu	Me	Me	Me
Ph	Me	COEt	Me	Me	Me
Ph	Me	Me	Me	Me	Me
Ph	Me	Et	Me	Me	Me
Ph	Me	SO ₂ Me	Me	Me	Me
Ph	Me	SO ₂ Me ₂	Me	Me	Me
Ph	Me	COtBu	Me	Me	Me
Ph	Me	CO-(2-C1)-Ph	Me	Me	Me
Ph	Me	CO-(3-C1)-Ph	Me	Me	Me
Ph	Me	CO-(4-C1)-Ph	Me	Me	Me
Ph	Me	COtBu	Et	Me	Me

【0096】

【表4】

A	R'	R''	R'''	R''''	R'''''
Ph	Me	COtBu	nPen	Me	Me
Ph	Me	COtBu	iPen	Me	Me
Ph	Me	COtBu	nBu	Me	Me
Ph	Me	COtBu	iBu	Me	Me
Ph	Me	COtBu	sBu	Me	Me
Ph	Me	COtBu	tBu	Me	Me
Ph	Me	COtBu	Me	Et	Me
Ph	Me	COtBu	Me	nPen	Me
Ph	Me	COtBu	Me	iPen	Me
Ph	Me	COtBu	Me	nBu	Me
Ph	Me	COtBu	Me	iBu	Me
Ph	Me	COtBu	Me	sBu	Me
Ph	Me	COtBu	Me	tBu	Me
Ph	Me	COtBu	Me	Me	Et
Ph	Me	COtBu	Me	Me	nPen
Ph	Me	COtBu	Me	Me	iPen
Ph	Me	COtBu	Me	Me	nBu
Ph	Me	COtBu	Me	Me	iBu
Ph	Me	COtBu	Me	Me	sBu
Ph	Me	COtBu	Me	Me	tBu

【0097】本発明化合物を害虫防除剤として施用するにあたっては、通常適当な固体担体又は液体担体と混合し、更に所望により界面活性剤、浸透剤、展着剤、増粘剤、凍結防止剤、結合剤、固結防止剤、崩壊剤および分解防止剤等を添加して、液剤、乳剤、水和剤、水溶剤、顆粒水和剤、顆粒水溶剤、懸濁剤、乳濁剤、サスボエマルジョン、マイクロエマルジョン、粉剤、粒剤およびゲル剤等任意の剤型の製剤にて実用に供することができる。また、省力化および安全性向上の観点から、上記任

意の剤型の製剤を水溶性包装体に封入して供することもできる。

【0098】固体担体としては、例えば石英、カオリナイト、パイロフィライト、セリサイト、タルク、ベントナイト、酸性白土、アタパルジャイト、ゼオライトおよび珪藻土等の天然鉱物質類、炭酸カルシウム、硫酸アンモニウム、硫酸ナトリウムおよび塩化カリウム等の無機塩類、合成珪酸ならびに合成珪酸塩が挙げられる。

【0099】液体担体としては、例えばエチレングリコール、プロピレングリコールおよびイソプロパノール等のアルコール類、キシレン、アルキルベンゼンおよびアルキルナフタレン等の芳香族炭化水素類、ブチルセロソルブ等のエーテル類、シクロヘキサノン等のケトン類、γ-ブチロラクトン等のエステル類、N-メチルピロリドン、N-オクチルピロリドン等の酸アミド類、大豆油、ナタネ油、綿実油およびヒマシ油等の植物油ならびに水が挙げられる。

【0100】これら固体および液体担体は、単独で用いても2種以上を併用してもよい。

【0101】界面活性剤としては、例えばポリオキシエチレンアルキルエーテル、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル、ポリオキシエチレンスチルルフェニルエーテル、ポリオキシエチレンポリオキシプロピレンブロックコポリマー、ポリオキシエチレン脂肪酸エステル、ソルビタン脂肪酸エステルおよびポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル等のノニオン性界面活性剤、アルキル硫酸塩、アルキルベンゼンスルホン酸塩、リグニンスルホン酸塩、アルキルスルホコハク酸塩、ナフタレンスルホン酸塩、アルキルナフタレンスルホン酸塩、ナフタレンスルホン酸のホルマリン縮合物の塩、アルキルナフタレンスルホン酸のホルマリン縮合物の塩、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル硫酸および燐酸塩、ポリオキシエチレンスチルルフェニルエーテル硫酸および燐酸塩、ポリカルボン酸塩およびポリスチレンスルホン酸塩等のアニオン性界面活性剤、アルキルアミン塩およびアルキル4級アンモニウム塩等のカチオン性界面活性剤ならびにアミノ酸型およびベタイン型等の両性界面活性剤が挙げられる。

【0102】これら界面活性剤の含有量は、特に限定されるものではないが、本発明の製剤100重量部に対し、通常0.05~20重量部の範囲が望ましい。また、これら界面活性剤は、単独で用いても2種以上を併用してもよい。

【0103】また、本発明化合物を農薬として使用する場合には必要に応じて製剤時または散布時に他種の除草剤、各種殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺菌剤、植物生長調節剤、共力剤、肥料、土壌改良剤などと混合施用してもよい。

【0104】特に他の農薬あるいは植物ホルモンと混合施用することにより、施用薬量の減少による低コスト

化、混合薬剤の相乗作用による殺虫スペクトラムの拡大や、より高い有害生物防除効果が期待できる。この際、同時に複数の公知農薬との組み合わせも可能である。本発明化合物と混合使用する農薬の種類としては、例えば、ファーム・ケミカルズ・ハンドブック (Farm Chemicals Handbook) 1994年版に記載されている化合物などがある。具体的にその一般名を例示すれば次の通りであるが、必ずしもこれらのみ限定されるものではない。

【0105】殺菌剤：アシベンゾール (acibenzolar), アムプロビルホス (ampropyfos), アニラジン (anilazine), アザコナゾール (azaconazole), アゾキシストロビン (azoxystrobin), ベナラキシル (benalaxyl), ベノダニル (benodanil), ベノミル (benomy), ベンザマクリル (benzamacril), ビナパクリル (binapacryl), ビフェニル (biphenyl), ビテルタノール (bitertanol), ベトキサジン (bethoxazine), ボルドー液 (bordeaux mixture), プラストサイジン S (blasticidin-S), プロモコナゾール (bromoconazole), ブピリメート (bupirimate), ブチオベート (butiobate), カルシウムポリスルフィド (calcium polysulfide), キャプタフォール (captafol), キャプタン (captan), カッパーオキシクロリド (copper oxychloride), カルプロバミド (carpropamid), カルベンダジン (carbendazim), カルボキシシン (carboxin), キノメチオネート (chinomethionat), クロベンチアゾン (chlobenthiazone), クロルフエナゾール (chlorfenazol), クロロネブ (chloroneb), クロロタロニル (chlorothalonil), クロゾリネート (chlozoline), クフラネブ (cufraneb),

【0106】ジメキサニル (cymoxanil), シプロコナゾール (cyproconazole), シプロジニル (cyprodinil), シプロフラム (cyprofuram), デバカルブ (debarb), ジクロロフェン (dichlorophen), ジクロブトラゾール (diclobutrazol), ジクロフラニド (diclho fluanid), ジクロメジン (diclomedine), ジクロラン (dicloran), ジエトフェンカルブ (diethofencarb), ジクロシメット (diclocymet), ジフェノコナゾール (difenoconazole), ジフルメトリン (diflumerol), ジメチリモール (dimethirimol),

【0107】ジメトモルフ (dimethomorph), ジニコナゾール (diniconazole), ジニコナゾール-M (diniconazole-M), ジノカップ (dinocap), ジフェニルアミン (diphenylamine), ジピリチオン (dipyrrithione), ジタリムホス (ditalimfos), ジチアノン (dithianon), ドデモルフ (dodemorph), ドジン (dodine), ドラゾクソロン (drazoxolon), エデフェノホス (edifenphos), エポキシコナゾール (epoxiconazole), エタコナゾール (etaconazole), エチリモール (ethirimol), エトリジアノール (etridiazole), ファモキサゾ

ン (famoxadone), フェナリモル (fenarimol), フェブコナゾール (febuconazole), フェンフラム (fenfuram),

【0108】フェンピクロニル (fempiclonil), フェンプロビジン (fenpropidin), フェンプロビモルフ (fenpropimorph), フェンチン (fentin), フェルバン (ferbam), フェリムゾン (ferimzone), フルアジナム (fluazinam), フルジオキソニル (fludioxonil), フルオロイミド (fluoroimide), フルキンコナゾール (fluquinconazole), フルシラゾール (flusilazole), フルスルファミド (flusulfamide), フルトラニル (flutolanil), フルトリアフォール (flutriafo), フォルベット (folpet), フォセチル-アルミニウム (fosetyl-aluminium), フベリダゾール (fuberidazole), フララキシル (furalaxyl), フェナミドン (fenamidone), フェンヘキサミド (fenhexamid),

【0109】グアザチン (guazatine), ヘキサクロロベンゼン (hexachlorobenzene), ヘキサコナゾール (hexaconazole), ヒメキサゾール (hymexazol), イマザリル (imazalil), イミベンコナゾール (imibenconazole), イミノクタジン (iminocladine), イブコナゾール (ipconazole), イプロベンホス (iprobenfos), イプロジオン (iprodione), イソプロチオラン (isoprotiolane), イプロバリカルブ (iprovalicarb),

【0110】カスガマイシン (kasugamycin), クレソキシム-メチル (kresoxim-methyl), マンカップ (mancozeb), マンコゼブ (mancozeb), マンネブ (maneb), メバニピリム (mepanipyrim), メプロニル (meproconil), メトラキシル (metalaxyl), メトコナゾール (metconazole), メチラム (metiram), メトミノストロビン (metominostrobin), ミクロブタニル (myclobutanil), ナバム (nabam), ニッケルビス (ジメチルジチオカーバメート) (nickel bis(dimethyldithiocarbamate)), ニトロタール-イソプロピル (nitrothal-isopropyl), ヌアリモル (nuarimol), オクチリノン (octhlinone), オフレース (ofurace), オキサジキシル (oxadixyl), オキシカルボキシシン (oxycarboxin), オキボコナゾールフマル酸塩 (oxpoconazole fumarate),

【0111】ペフラズエート (pefurzoate), ペンコナゾール (penconazole), ペンシクロン (pencycuro), フタライド (phthalide), ピペラリン (piperalin), ポリオキシシン (polyoxins), プロベナゾール (probenazole), プロクロラズ (prochloraz), プロシミドン (procymidone), プロバモカルブ塩酸塩 (propamocarb hydrochloride), プロビコナゾール (propiconazole), プロビネブ (propineb), ピラゾホス (pyrazophos), ピリフェノックス (pyrifeno), ピリメタニル (pyrimethanil), ピロキロン (pyroquilon), キノキシフェン (quinoxifen), キントゼン (quintozen)

e)、

【0112】硫黄(sulfur)、スピロキサミン(spiroamine)、テブコナゾール(tebuconazole)、テクナゼン(tecnazene)、テトラコナゾール(tetraconazole)、チアベンダゾール(thiabendazole)、チフルザミド(thifluzamide)、チオファネートメチル(thiophanate-methyl)、チラム(thiram)、トルクロホスーメチル(tolclofos-methyl)、トリルフラニド(tolylflu anid)、トリアジメホン(triadimefon)、トリアジメノール(toriadimenol)、トリアゾキシド(triazoxid e)、トリシクラゾール(tricyclazole)、トリデモルフ(tridemorph)、トリフルミゾール(triflumizol e)、トリホリン(triforine)、トリチコナゾール(tr iticonazole)、バリダマイシン(validamycin)、ビンクロゾリン(vinclozolin)、ジネブ(zineb)及びジラム(ziram)など。

【0113】殺バクテリア剤: ストレプトマイシン(st reptomycin)、オキシテトラサイクリン(oxytetracycl ine)及びオキシソリニックアシド(oxolinic acid)な ど。

【0114】殺線虫剤: アルドキシカルブ(aldoxycar b)、フォスチアゼート(fosthiatate)、フォスチエタ ン(fosthietan)、オキサミル(oxamyl)及びフェナミ ホス(fenamiphos)など。

【0115】殺ダニ剤: アミトラズ(amitraz)、プロ モプロピレート(bromopropylate)、チノメチオネート (chinomethionat)、クロロベンジラート(chlorobezi late)、クロフェンテジン(clofentezine)、サイヘキ サチン(cyhexatine)、ジコフォーラ(dicofol)、ジ エノクロール(dienochlor)、エトキサゾール(etoxaz ole)、フェナザキン(fenazaquin)、フェンブタチン オキシド(fenbutatin oxide)、フェンプロパトリン (fenpropathrin)、フェンプロキシメート(fenproxim ate)、ハルフェンプロックス(halfenprox)、ヘキシ チアゾックス(hexythiazox)、ミルベメクチン(milbe mectin)、プロパルギット(propargite)、ピリダベン (pyridaben)、ピリミジフェン(pyrimidifen)及びテ ブフェンピラド(tebufenpyrad)など。

【0116】殺虫剤: アバメクチン(abamectin)、ア セフェート(acephate)、アセタミピリド(acetamipir id)、アジンホスーメチル(azinphos-methyl)、ベン ジオカルブ(bendiocarb)、ベンフラカルブ(benfurac arb)、ベンスルタップ(bensultap)、ビフェントリン (bifenthrin)、ブプロフェジン(buprofezin)、ブト カルボキシシン(butocarboxim)、カルバリル(carbary l)、カルボフラン(carbofuran)、カルボスルファン (carbosulfan)、カルタップ(cartap)、クロルフェ ナビル(chlorfenapyr)、クロルピリホス(chlorpyrif os)、クロルフェンビンホス(chlorfenvinphos)、ク ロルフルアズロン(chlorfluazuron)、クロチアニジン

(clothianidin)、クロマフェノジド(chromafenozid e)、クロピリホスーメチル(chlorpyrifos-methyl)、 シフルトリン(cyfluthrin)、ベーターシフルトリン (beta-cyfluthrin)、シベルメトリン(cypermethri n)、シロマジン(cyromazine)、

【0117】シハロトリン(cyhalothrin)、ラムダー シハロトリン(lambda-cyhalothrin)、デルタメトリン (deltamethrin)、ジアフェンチウロン(diafenthuiro n)、ダイアジノン(diazinon)、ジアクロデン(diacl oden)、ジフルベンズロン(diflubenzuron)、ジメチ ルビンホス(dimethylvinphos)、ジオフェノラン(dio fenolan)、ジスルフォトン(disulfoton)、ジメトエ ート(dimethoate)、EPN、エスフェンバレレート(esf envalerate)、エチオフェンカルブ(ethiofencarb)、 エチプロール(ethiprole)、エトフェンプロックス(e tofenprox)、エトリムホス(etrimfos)、フェニトロ チオン(fenitrothion)、フェノブカルブ(fenobucar b)、フェノキシカーブ(fenoxycarb)、フェンプロバ トリン(fenpropathrin)、フェンバレレート(fenvale rate)、フィプロニル(fipronil)、フルシトリネート (flucythrinate)、フルフェノクスウロン(flufenoxu ron)、フルフェンプロックス(flufenprox)、タウー フルバリネート(tau-fluvalinate)、ホノホス(fonop hos)、フォルメタネート(formetanate)、フォルモチ オン(formothion)、フラチオカルブ(furathiocar b)、

【0118】ハロフェノジド(halofenozide)、ヘキサ フルムロン(hexaflumuron)、ヒドラメチルノン(hydr amethylnon)、イミダクロプリド(imidacloprid)、イ ソフェンホス(isofenphos)、インドキサカルブ(indo xacarb)、イソプロカルブ(isoprocab)、イソキサチ オン(isoxathion)、ルフエヌウロン(lufenuron)、 マラチオン(malathion)、メタルデヒド(metaldehyd e)、メタミドホス(methamidophos)、メチダチオン (methidathion)、メタクリホス(methacrifos)、メ タルカルブ(metalcarb)、メソミル(methomyl)、メ ソブレン(methoprene)、メトキシクロール(methoxyc hlor)、メトキシフェノジド(methoxyfenozide)、モ ノクロトホス(monocrotophos)、ムスカールレ(musca lure)、ニテンピラム(nitenpyram)、オメトエート (omethoate)、オキシデメトンメチル(oxydemeton- methyl)、オキサミル(oxamyl)、

【0119】パラチオン(parathion)、パラチオンメチル(parathion-methyl)、ペルメトリン(permethr in)、フェントエート(phenthoate)、フォキシム(ph oxim)、ホレート(phorate)、ホサロン(phosalon e)、ホスメット(phosmet)、ホスファミドン(phosph amidon)、ピリミカルブ(pirimicarb)、ピリミホスー メチル(pirimiphos-methyl)、プロフェノホス(profe nofos)、ピメトロジン(pymetrozine)、ピラクロホス

(pyraclofos)、ピリプロキシフェン (pyriproxyfen)、ロテノン (rotenone)、スルプロホス (sulprofos)、シラフルオフェン (silaflofen)、スピノサド (spinosad)、スルホテップ (sulfotep)、テブフェンジド (tebfenozide)、テフルベンズロン (teflubenzuron)、テフルトリン (tefluthrin)、テルブホス (terbufos)、テトラクロロビノホス (tetrachlorvinphos)、チオジカルブ (thiodicarb)、チアメトキサム (thiamethoxam)、チオファノックス (thiofanox)、チオメトン (thiometon)、トルフェンピラド (tolfenpyrad)、トラロメスリン (tralomethrin)、トリクロルホン (trichlorfon)、トリアズロン (triazuron)、トリフルムロン (triflumuron) 及びバミドチオン (vamidot hion) など。

【0120】本発明化合物の施用量は適用場面、施用時期、施用方法、栽培作物等により差異はあるが一般には有効成分量としてヘクタール (ha) 当たり0.005~50kg程度が適当である。

【0121】次に具体的に本発明化合物を用いる場合の製剤の配合例を示す。但し本発明の配合例は、これらのみに限定されるものではない。なお、以下の配合例において「部」は重量部を意味する。

【0122】〔水和剤〕

本発明化合物	0.1~80部
固体担体	5~98.9部
界面活性剤	1~10部
その他	0~5部

その他として、例えば固結防止剤、分解防止剤等があげられる。

【0123】〔乳剤〕

本発明化合物	0.1~30部
液体担体	45~95部
界面活性剤	4.9~15部
その他	0~10部

その他として、例えば展着剤、分解防止剤等が挙げられる。

【0124】〔懸濁剤〕

本発明化合物	0.1~70部
液体担体	15~98.89部
界面活性剤	1~12部
その他	0.01~30部

その他として、例えば凍結防止剤、増粘剤等が挙げられる。

【0125】〔顆粒水和剤〕

本発明化合物	0.1~90部
固体担体	0~98.9部
界面活性剤	1~20部
その他	0~10部

その他として、例えば結合剤、分解防止剤等が挙げられる。

【0126】〔液剤〕

本発明化合物	0.01~70部
液体担体	20~99.99部
その他	0~10部

その他として、例えば凍結防止剤、展着剤等が挙げられる。

【0127】〔粒剤〕

本発明化合物	0.01~80部
固体担体	10~99.99部
その他	0~10部

その他として、例えば結合剤、分解防止剤等が挙げられる。

【0128】〔粉剤〕

本発明化合物	0.01~30部
固体担体	65~99.99部
その他	0~5部

その他として、例えばドリフト防止剤、分解防止剤等が挙げられる。

【0129】〔製剤例〕次に、本発明化合物を有効成分とする有害生物防除剤の具体的な製剤例を示すが、本発明はこれらに限定されるものではない。

【0130】尚、以下の製剤例において、「部」は重量部を意味する。

【0131】〔配合例1〕水和剤

本発明化合物No. 2	20部
バイロフィライト	76部
ソルボール5039	2部

(非イオン性界面活性剤とアニオン性界面活性剤との混合物：東邦化学工業(株)商品名)

カーブレックス#80D	2部
-------------	----

(合成含水珪酸：塩野義製薬(株)商品名)

以上を均一に混合粉砕して水和剤とする。

【0132】〔配合例2〕乳剤

本発明化合物No. 2	5部
キシレン	75部
N-メチルピロリドン	15部
ソルボール2680	5部

(非イオン性界面活性剤とアニオン性界面活性剤との混合物：東邦化学工業(株)商品名)

以上を均一に混合して乳剤とする。

【0133】〔配合例3〕懸濁剤(フロアブル剤)

本発明化合物No. 2	25部
アグリゾールS-710	10部

(非イオン性界面活性剤：花王(株)商品名)

ルノックス1000C	0.5部
------------	------

(アニオン性界面活性剤：東邦化学工業(株)商品名)

キサンタンガム	0.2部
水	64.3部

以上を均一に混合した後、湿式粉砕して懸濁剤とする。

50 【0134】

27

〔配合例4〕顆粒水和剤（ドライフロアブル剤）

本発明化合物No. 2 75部
 ハイテノールNE-15 5部
 （アニオン性界面活性剤：第一工業製薬（株）商品名）
 バニレックスN 10部
 （アニオン性界面活性剤：日本製紙（株）商品名）
 カーブレックス#80D 10部
 （合成含水珪酸：塩野義製薬（株）商品名）

以上を均一に混合粉碎した後、少量の水を加えて攪拌混合し、押出式造粒機で造粒し、乾燥して顆粒水和剤とする。

【0135】〔配合例5〕粒 剤

本発明化合物No. 2 5部
 ベントナイト 50部
 タルク 45部

以上を均一に混合粉碎した後、少量の水を加えて攪拌混合し、押出式造粒機で造粒し、乾燥して粒剤とする。

【0136】〔配合例6〕粉 剤

本発明化合物No. 2 3部
 カーブレックス#80D 0.5部
 （合成含水珪酸：塩野義製薬（株）商品名）

カオリナイト 95部
 リン酸ジイソプロピル 1.5部

以上を均一に混合粉碎して粉剤とする。

【0137】使用に際しては上記水和剤、乳剤、フロアブル剤、顆粒水和剤は水で50～20000倍に希釈して有効成分が1ヘクタール（ha）当たり0.005～50kgになるように散布する。

【0138】

【実施例】以下に本発明化合物の合成例、製剤例、試験例を実施例として具体的に述べるが、本発明はこれらによって限定されるものではない。

【0139】〔合成例1〕3-(1,4-ジメチルピラゾール-5-イル)-3-ヒドロキシ-2-(1-メチル-3-フェニル-1,2,4-トリアゾール-5-イル)-アクリロニトリル（化合物No. 1）の合成

5-シアノメチル-1-メチル-3-フェニル-1,2,4-トリアゾール0.5g及び1,4-ジメチルピラゾール-5-カルボニルクロライド0.48gをテトラヒドロフラン50mlに溶解し、氷冷化にてターシャリーブトキシカリウム0.71gを加えた。室温で一晩攪拌した後、減圧下で溶媒を留去して得られた油状物を水50mlに溶解し、トルエンで洗浄、水層を濃塩酸で酸性とし、酢酸エチルで抽出、水洗、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を減圧下で留去して得られた固体をイソプロピルエーテルで洗浄し、標記目的化合物0.46gを得た。融点：188-191℃

【0140】〔合成例2〕3-(1,4-ジメチルピラゾール-5-イル)-(1-メチル-3-フェニル-1,2,4-トリアゾール-5-イル)-3-ヒバロイルオキシアクリロニトリル（化合物No. 2）の合成

28

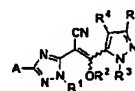
3-(1,4-ジメチルピラゾール-5-イル)-3-ヒドロキシ-2-(1-メチル-3-フェニル-1,2,4-トリアゾール-5-イル)-アクリロニトリル0.3gをクロロホルム50mlに溶解し、トリエチルアミン0.09gを加えて氷冷し、ヒバロイルクロライド0.11gを滴下した。室温で一晩攪拌した。反応混合物を水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧下で溶媒を留去して得られた粗生成物をシリカゲルクロマトグラフィー（クロロホルム/酢酸エチル=3/1）で精製して標記目的化合物0.21g（E体とZ体の3/2混合物）を得た。融点：130-133℃

【0141】前記スキームあるいは上記合成例に準じて合成した本発明化合物の構造と融点を第2表に示すが、特に記載のないものはE体とZ体の混合物である。なお、表中の略号は前記と同じ意味を表す。

【0142】〔第2表〕

【0143】

【化5】



【0144】

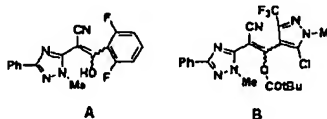
【表5】

No.	A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	融点(℃)、異性体比
1	Ph	Me	H	Me	Me	H	188-191℃
2	Ph	Me	CO ₂ Bu	Me	Me	H	130-133℃、3/1
3	Ph	Me	H	Me	H	Me	200-208℃
4	Ph	Me	CO ₂ Bu	Me	H	Me	固形物、3/2
5	Ph	Me	H	Me	Cl	Me	150-161℃
6	Ph	Me	CO ₂ Bu	Me	Cl	Me	固形物、3/1
7	Ph	Me	H	Me	Cl	Et	119-121℃
8	Ph	Me	CO ₂ Bu	Me	Cl	Et	153-154℃、E体またはZ体
9	Ph	Me	H	Me	Me	Me	166-169℃
10	Ph	Me	CO ₂ Bu	Me	Me	Me	固形物、1/1
11	Ph	Me	H	Me	OBu	Me	144-150℃
12	Ph	Me	CO ₂ Bu	Me	OBu	Me	129-132℃、3/1
13	Ph	nHex	H	Me	Me	Me	85-88℃
14	Ph	nHex	CO ₂ Bu	Me	Me	Me	固形物、5/1

【0145】〔試験例〕次に、本発明化合物の有害生物防除剤としての有用性について、以下の試験例において具体的に説明する。尚、対照化合物として下記の化合物Aおよび化合物Bを用いた。化合物AはW098/42683公報第2表記載の化合物No. 2-1であり、化合物BはW0/42683公報第4表の化合物No. 4-1からの誘導体である。

【0146】

【化6】



【0147】

〔試験例1〕 ナミハダニ幼虫に対する殺虫試験

インゲンの葉をリーフパンチを用いて径3.0cmの円形に切り取り、径7cmのスチロールカップ上の湿った濾紙上に置いた。これにナミハダニ幼虫を1葉当たり10頭接種した。明細書に記載された本発明化合物及び対照化合物Aの5%乳剤（化合物によっては25%水和剤を供試）を展着剤の入った水で希釈して100ppm濃度に調整し、この薬液をスチロールカップ当たり2mlづつ回転式散布塔を用いて散布し、25℃の恒温室に収容し、96時間経過後の死虫率を下記の計算式から求めた。尚、試験は2区制でおこなった。

【0148】

【数1】

$$\text{死虫率} = \{ \text{死虫数} / (\text{死虫数} + \text{生存虫数}) \} \times 100$$

【0149】その結果、以下の化合物が80%以上の死虫率を示した。

化合物No. : 2, 4, 5, 6, 9, 10, 13, 14。

一方、対照に用いた化合物Aは100ppm濃度でなんら効果を示さなかった。

【0150】

〔試験例2〕 ナミハダニ雌成虫に対する殺虫試験

インゲンの葉をリーフパンチを用いて径3.0cmの円形に切り取り、径7cmのスチロールカップ上の湿った濾

紙上に置いた。これにナミハダニ雌成虫を1葉当たり10頭接種した。本発明化合物No.14及び対照化合物Bの5%乳剤を展着剤の入った水で希釈して1.6~50ppm濃度に調整し、この薬液をスチロールカップ当たり2mlづつ回転式散布塔を用いて散布し、25℃の恒温室に収容し、48時間経過後の死虫率を試験例1の計算式から求めた。尚、試験は2区制でおこなった。結果を第3表に示す。

【0151】

【表6】

【第3表】

有効成分濃度 (ppm)	死虫率 (%)	
	化合物No. 14	化合物B
50	100	90
25	100	50
12.5	90	10
6.3	95	0
3.1	40	
1.6	5	

【0152】

【発明の効果】本発明の化合物は、優れた有害生物防除活性を示す。

フロントページの続き

(72)発明者 三宅 敏郎

埼玉県南埼玉郡白岡町大字白岡1470 日産
化学工業株式会社生物科学研究所内

(72)発明者 瀧井 新自

埼玉県南埼玉郡白岡町大字白岡1470 日産
化学工業株式会社生物科学研究所内

(72)発明者 伊藤 俊紀

埼玉県南埼玉郡白岡町大字白岡1470 日産
化学工業株式会社生物科学研究所内

Fターム(参考) 4C063 AA01 AA03 BB04 CC41 CC78
DD12 DD22 EE03
4H011 AC02 AC04 BB09 DA02 DA15
DA16 DD03